

(12) NACH DEM VERTÜBLICHEN ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
21. Oktober 2004 (21.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/089872 A1(51) Internationale Patentklassifikation?: C07C 217/62,  
A61K 31/135, C07C 213/10, A61P 13/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/003567

(22) Internationales Anmeldedatum:  
3. April 2004 (03.04.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 15 917.7 8. April 2003 (08.04.2003) DE(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): SCHWARZ PHARMA AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-  
Strasse 10, 40789 Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BREITENBACH,  
Armin [DE/DE]; Opladener Strasse 108, 40789 Mon-  
heim (DE). MEESE, Claus [DE/DE]; Kreuzberger Str.  
50, 40789 Monheim (DE). WOLFF, Hans-Michael  
[DE/DE]; Richard-Wagner-Strasse 2, 40789 Monheim  
(DE). DREWS, Roland [DE/DE]; Ulmenweg 24, 40789  
Monheim (DE).(74) Gemeinsamer Vertreter: SCHWARZ PHARMA AG;  
Schacht, D., W., Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim  
(DE).(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,  
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

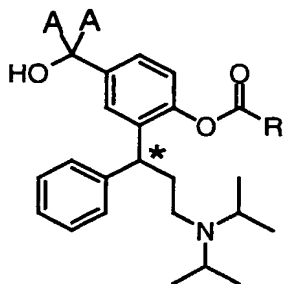
## Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: HIGHLY PURE BASES OF 3,3-DIPHENYL PROPYLAMINE MONOESTERS

(54) Bezeichnung: HOCHREINE BASEN VON 3,3-DIPHENYLPROPYLAMINMONOESTERN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to a compound  
of general formula (I) wherein A represents deuterium  
or hydrogen, R represents a group selected from  
C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>3-10</sub> cycloalkyl or phenyl, which can  
be substituted by C1-3 alkoxy, fluorine, chlorine,  
bromine, iodine, nitro, amino, hydroxyl, oxo,  
mercapto or deuterium. The C atom marked with  
a \* (star) can be present in an (R) configuration,  
in an (S)-configuration or a mixture thereof. The  
invention is characterised in that the above-mentioned  
compounds are free bases with a degree of purity of  
more than 97 wt %. The invention also relates to a  
method for the production of highly pure compounds

of general formula (I) and to the use thereof in the production of medicaments.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft eine Verbindung der allgemeinen Formel (I), wobei A Deuterium oder  
Wasserstoff ist, R für eine Gruppe steht, die ausgewählt ist aus C<sub>1-6</sub>Alkyl, C<sub>3-10</sub> Cycloalkyl oder Phenyl, die jeweils mit C1-3Alkoxy,  
Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Amino, Hydroxy, Oxo, Mercapto oder Deuterium substituiert sein kann und wobei das mit \*-(Stern)  
markierte C-Atom in (R)-Konfiguration, in (S)-Konfiguration oder als Mischung davon vorliegen kann, dadurch charakterisiert, dass  
die besagte Verbindung als freie Base mit einem Reinheitsgrad von über 97 Gew% vorliegt. Ferner betrifft die Erfindung ein Ver-  
fahren zur Herstellung hochreiner Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sowie die Verwendung der hochreinen Verbindungen  
zur Herstellung von Arzneimitteln.